

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開2001-335559

(P2001-335559A)

(43)公開日 平成13年12月4日 (2001.12.4)

(51)Int.Cl.<sup>7</sup>  
C 07 C 381/12  
A 01 N 41/10

識別記号

F I  
C 07 C 381/12  
A 01 N 41/10

テマコード(参考)  
4 H 0 0 6  
Z 4 H 0 1 1

審査請求 未請求 請求項の数5 OL (全20頁)

(21)出願番号

特願2000-156791(P2000-156791)

(22)出願日

平成12年5月26日 (2000.5.26)

(71)出願人 000232623

日本農業株式会社  
東京都中央区日本橋1丁目2番5号

(72)発明者 遠西 正範

大阪府堺市福田1040-1-408

(72)発明者 森本 雅之

大阪府河内長野市西之山町1-28-305

(72)発明者 藤岡 伸祐

大阪府河内長野市上原町474-1-103

(72)発明者 瀬尾 明

和歌山县橋本市紀見ヶ丘2丁目3番19号

(74)代理人 100068618

弁理士 萩 経夫 (外2名)

最終頁に続く

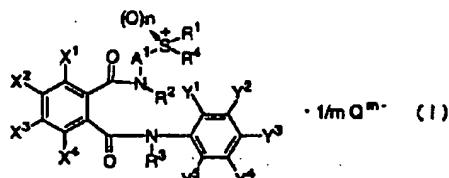
(54)【発明の名称】 フタル酸ジアミド誘導体及び農園芸用殺虫剤並びにその使用方法

(57)【要約】 (修正有)

酸ジアミド誘導体、農園芸用殺虫剤及びその使用方法。

【解決手段】 式(I) :

【効果】 式(I) のフタル酸ジアミド誘導体は農園芸用殺虫剤として優れた防除効果を示す。

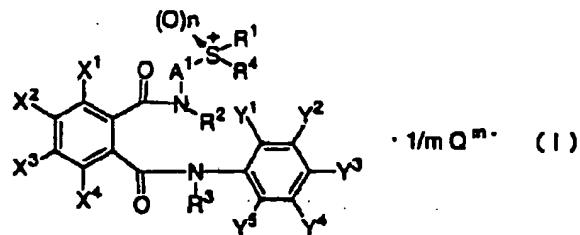


{式中、A<sup>1</sup> はアルキレン、アルケニレン、アルキニレン等、R<sup>1</sup> は(ハロ)シクロアルキル、フェニル、複素環、-A<sup>2</sup>-R<sup>5</sup> (式中、A<sup>2</sup> は(ハロ)アルキレン、(ハロ)アルケニレン等、R<sup>5</sup> はH、ハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>、(ハロ)シクロアルキル、アルコキシカルボニル、フェニル、複素環等、R<sup>2</sup> とR<sup>3</sup> はH、シクロアルキル、-A<sup>2</sup>-R<sup>5</sup> 等、R<sup>4</sup> はアルキル、アルケニル、フェニル、複素環等、nは0~1、X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>、X<sup>3</sup>、X<sup>4</sup>、Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup>、Y<sup>3</sup>、Y<sup>4</sup> 及びY<sup>5</sup> はH、ハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>、(ハロ)シクロアルキル、アルコキシカルボニル、フェニル、複素環等、Qは農業上許容しうるアニオンから選択される化合物、mは1~2} のフタル

#### 【特許請求の範囲】

【請求項 1】 一般式(I)；

【化1】



ルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルカルボニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又は  $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^2-R^5$ （式中、 $A^2$ は $C_1-C_8$ アルキレン基、ハロ  $C_1-C_8$ アルキレン基、 $C_3-C_6$ アルケニレン基、ハロ  $C_3-C_6$ アルケニレン基、 $C_3-C_6$ アルキニレン基又はハロ  $C_3-C_6$ アルキニレン基を示し、 $R^5$ は水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキル基、ハロ  $C_3-C_6$ シクロアルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又は  $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又は  $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は $-Z^1-R^6$ （式中、 $Z^1$ は $-O-$ 、 $-SO_2-$ 又は $-N(R^7)$ ）—（式中、 $R^7$ は $C_1-C_6$ アルキルカルボニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルカルボニル基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又は  $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル基、フェニル  $C_1-C_6$ アル

ルコキシカルボニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル $C_1-C_4$ アルコキシカルボニル基を示す。)を示し、 $R^6$ は水素原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_3-C_6$ アルケニル基、ハロ $C_3-C_6$ アルケニル基、 $C_3-C_6$ アルキニル基、ハロ $C_3-C_6$ アルキニル基、 $C_3-C_6$ シクロアルキル基、ハロ $C_3-C_6$ シクロアルキル基、 $C_1-C_6$ アルキルカルボニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルカルボニル基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニル $C_1-C_4$ アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル $C_1-C_4$ アルコキシカルボニル基を示す。)

又、 $R^1$ は $A^1$ と結合して、1~2個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い5~8員環を形成することができる。 $R^2$ 及び $R^3$ は同一又は異なっても良く、水素原子、 $C_3-C_6$ シクロアルキル基又は $-A^2-R^5$ (式中、 $A^2$ 及び $R^5$ は前記に同じ。)を示す。又、 $R^2$ は $A^1$ 又は $R^1$ と結合して、1~2個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い5~7員環を形成することができる。 $R^4$ は $C_1-C_6$ アルキル基、

$C_3-C_6$ アルケニル基、 $C_3-C_6$ アルキニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_3-C_6$ シクロアルキル基、 $C_1-C_4$ アルコキシ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_4$ アルコキシカルボニル $C_1-C_6$ アルキル基、シアノ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_4$ アルキルカルボニル $C_1-C_6$ アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ シクロアルキル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニル $C_1-C_4$ アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル $C_1-C_4$ アルキル基、フェニルカルボニル $C_1-C_4$ アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル $C_1-C_4$ アルキル基を示す。又、 $R^4$ は $A^1$ 又は $R^1$ と結合して、1~2個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い5~7員環を形成することができる。 $n$ は0~1の整数を示す。 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$ 及び $X^4$ は同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキル基、ハロ $C_3-C_6$ シクロアルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコ

キシ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ  $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ  $C_1-C_6$ アルキルアミノ基又は  $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^3-R^8$ （式中、 $A^3$ は $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(NOR^9)-$ （式中、 $R^9$ は水素原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_3-C_6$ アルケニル基、ハロ  $C_3-C_6$ アルケニル基、 $C_3-C_6$ アルキニル基、 $C_3-C_6$ シクロアルキル基、フェニル  $C_1-C_4$ アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ  $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なるても良いジ  $C_1-C_6$ アルキルアミノ基又は  $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上有する置換フェニル  $C_1-C_4$ アルキル基を示す。）、 $C_1-C_6$ アルキレン基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキレン基、 $C_2-C_6$ アルケニレン基、ハロ  $C_2-C_6$ アルケニレン基、 $C_2-C_6$ アルキニレン基又はハロ  $C_3-C_6$ アルキニレン基を示し、

ルスルフィニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ  $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なるっても良いジ  $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は  $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニルアミノ基、同一又は異なるっても良く、ハログン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフイニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ  $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なるっても良いジ  $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は  $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上有する置換フェニルアミノ基、複素環基又は同一若しくは異なるっても良く、ハログン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフイニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ  $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なるっても良いジ  $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は  $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示し、(3)  $A^3$  が  $C_1$ - $C_6$ アルキレン基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルキレン基、 $C_2$ - $C_6$ アルケニレン基、ハロ  $C_2$ - $C_6$ アルケニレン基、 $C_2$ - $C_6$ アルキニレン基又はハロ  $C_3$ - $C_6$ アルキニレン基を示す場合、 $R^8$  は水素原子、ハロゲン原子、 $C_3$ - $C_6$ シクロアルキル基、ハロ  $C_3$ - $C_6$ シクロアルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なるっても良く、ハログン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフイニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ  $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なるっても良いジ  $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は  $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なるっても良く、ハログン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフイニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ  $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なるっても良いジ  $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は  $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換

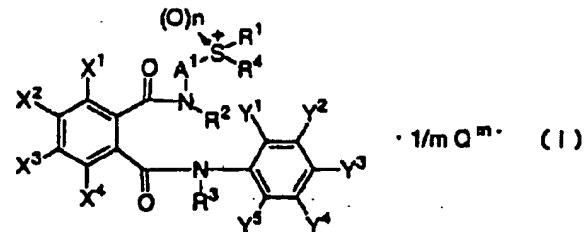
ニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する複素環基を示す。)を示す。)を示す。)を示す。又、フェニル環上の隣り合った $X^1$ 及び $X^2$ 、 $X^2$ 及び $X^3$ 又は $X^3$ 及び $X^4$ は一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。 $Y^1$ 、 $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$ 及び $Y^5$ は同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ $C_3$ - $C_6$ シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフ

イニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ  $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ  $C_1-C_6$ アルキルアミノ基又は  $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は- $A^3-R^8$ （式中、 $A^3$ 及び $R^8$ は前記に同じ。）を示す。又、フェニル環上の隣り合った $Y^1$ 及び $Y^2$ 、 $Y^2$ 及び $Y^3$ 、 $Y^3$ 及び $Y^4$ 又は $Y^4$ 及び $Y^5$ は一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハログン原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハログン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ  $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ  $C_1-C_6$ アルキルアミノ基又は  $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハログン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ  $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ  $C_1-C_6$ アルキルアミノ基又は  $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基から選択される1以上の置換基を有することもできる。Qは農業上許容しうるアニオンから選択される化合物を示し、mは1乃至2の整数を示す。}で表されるフタル酸ジアミド誘導体。

【請求項2】 Qがアニオン性対イオン、リン酸アミオン又はリン酸水素アニオンを示し、mは1乃至2の整数を示す請求項1記載のフタル酸ジアミド誘導体。

【請求項3】 アニオン性対イオンがハロゲンイオン、  
 $R^4\text{OSO}_3^-$  (式中、 $R^4$  は  $C_1\text{-}C_6$ アルキル基、 $C_3\text{-}C_6$ アルケニル基、 $C_3\text{-}C_6$ アルキニル基、ハロ $C_1\text{-}C_6$ アルキル基、 $C_3\text{-}C_6$ シクロアルキル基、 $C_1\text{-}C_4$ アルコキシ $C_1\text{-}C_6$ アルキル基、 $C_1\text{-}C_4$ アルコキシカルボニル $C_1\text{-}C_6$ アルキル基、シアノ $C_1\text{-}C_6$ アルキル基、 $C_1\text{-}C_4$ アルキルカルボニル $C_1\text{-}C_6$ アルキル基、フェニル基、同一又は異なるても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1\text{-}C_6$ アルキル基、ハロ $C_1\text{-}C_6$ アルキル基、 $C_1\text{-}C_6$ アルコキ

基、ハロ  $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又は  $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニル  $C_1-C_4$ アルキル基、同一又は異なっても良く、ハログン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルフニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又は  $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニルカルボニル  $C_1-C_4$ アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、ハログン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルフニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又は  $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル  $C_1-C_4$ アルキル基を示す。)、BF<sub>4</sub><sup>-</sup>、SbF<sub>6</sub><sup>-</sup>、SO<sub>3</sub><sup>-</sup>、HSO<sub>4</sub><sup>-</sup>、ClO<sub>4</sub><sup>-</sup>又はR<sup>14</sup>SO<sub>3</sub><sup>-</sup>(式中、R<sup>14</sup>はハログン原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハログン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル  $C_1-C_4$ アルキル基を示す。)



式中、 $A^1$  は  $C_1-C_8$  アルキレン基、同一又は異なっても良く、ハログン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ  $C_1-C_6$  アルキル基、 $C_1-C_6$  アルコキシ基、ハロ  $C_1-C_6$  アルコキシ基、 $C_1-C_6$  アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1-C_6$  アルキルスルホニル基又は  $C_1-C_6$  アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換  $C_1-C_8$  アルキレン基、 $C_3-C_8$  アルケニレン基、同一又は異なっても良く、ハログン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ  $C_1-C_6$  アルキル基、 $C_1-C_6$  アルコキシ基、ハロ  $C_1-C_6$  アルコキシ

ルスルホニル基又は C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。) である請求項 2 記載のフタル酸ジアミド誘導体。

【請求項4】 請求項1乃至3いずれか1項記載のフル酸ジアミド誘導体を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺虫剤。

**【請求項5】 農園芸上、望ましくない有害生物を防除するため、請求項4記載の農園芸用殺虫剤の有効量を対象有害生物が生息する植物又は植物が栽培されている土壤に処理することを特徴とする農園芸用殺虫剤の使用方法。**

## 【発明の詳細な説明】

[0 0 0 1]

【発明の属する技術分野】本発明は分子中にスルホニウム塩構造を含む新規なフタル酸ジアミド誘導体及び該化合物を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関するものである。

[0002]

【従来の技術】特開平11-240857号公報に本発明のフタル酸ジアミド誘導体に類似した化合物が開示されているが、分子中にスルホニウム塩構造を含む化合物は開示されていない。

[0003]

【発明が解決しようとする課題】本発明者等は新規な農園芸用殺虫剤を開発すべく銳意研究を重ねた結果、本発明の一般式(I)で表されるフタル酸ジアミド誘導体は文献未記載の新規化合物であり、農園芸用殺虫剤として有用であることを見いだし、本発明を完成させたものである。

[0 0 0 4]

【課題を解決するための手段】本発明は一般式(I)

【化2】

基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換 $C_3-C_8$ アルケニレン基、 $C_2-C_6$ アルキニレン基又は

【0005】同一若しくは異なつても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ  $C_1-C_6$  アルキル基、 $C_1-C_6$  アルコキシ基、ハロ  $C_1-C_6$  アルコキシ基、 $C_1-C_6$  アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1-C_6$  アルキルスルホニル基又は  $C_1-C_6$  アルコキカルボニル基から選択される1以上

の置換基を有する置換  $C_3$ - $C_8$  アルキニレン基を示す。又、前記  $C_1$ - $C_8$  アルキレン基、置換  $C_1$ - $C_8$  アルキレン基、 $C_3$ - $C_8$  アルケニレン基、置換  $C_3$ - $C_8$  アルケニレン基、 $C_3$ - $C_8$  アルキニレン基又は置換  $C_3$ - $C_8$  アルキニレン基中の任意の飽和炭素原子は  $C_2$ - $C_5$  アルキレン基で置換されて  $C_3$ - $C_6$  シクロアルカン環を示すこともでき、前記  $C_1$ - $C_8$  アルキレン基、置換  $C_1$ - $C_8$  アルキレン基、 $C_3$ - $C_8$  アルケニレン基、置換  $C_3$ - $C_8$  アルケニレン基中の任意の2個の炭素原子はアルキレン基又はアルケニレン基と一緒にになって  $C_3$ - $C_6$  シクロアルカン環又は  $C_3$ - $C_6$  シクロアルケン環を示すことができる。

【0006】 $R^1$  は  $C_3$ - $C_6$  シクロアルキル基、ハロ  $C_3$ - $C_6$  シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキル基、 $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基又は  $C_1$ - $C_6$  アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキル基、 $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基又は  $C_1$ - $C_6$  アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は- $A^2$ - $R^5$  (式中、 $A^2$  は  $C_1$ - $C_8$  アルキレン基、ハロ  $C_1$ - $C_8$  アルキレン基、 $C_3$ - $C_6$  アルケニレン基、ハロ  $C_3$ - $C_6$  アルケニレン基、 $C_3$ - $C_6$  アルキニレン基又はハロ  $C_3$ - $C_6$  アルキニレン基を示し、

【0007】 $R^5$  は水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_3$ - $C_6$  シクロアルキル基、ハロ  $C_3$ - $C_6$  シクロアルキル基、 $C_1$ - $C_6$  アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキル基、 $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基又は  $C_1$ - $C_6$  アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキル基、 $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基又は  $C_1$ - $C_6$  アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロ

ロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基又は  $C_1$ - $C_6$  アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は

【0008】- $Z^1$ - $R^6$  (式中、 $Z^1$  は- $O$ -、- $SO$ <sub>2</sub>-又は- $N$  ( $R^7$ ) - (式中、 $R^7$  は  $C_1$ - $C_6$  アルキルカルボニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルカルボニル基、 $C_1$ - $C_6$  アルコキシカルボニル基、フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキル基、 $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基又は  $C_1$ - $C_6$  アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル基、フェニル  $C_1$ - $C_4$  アルコキシカルボニル基又は

【0009】同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキル基、 $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基又は  $C_1$ - $C_6$  アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル  $C_1$ - $C_4$  アルコキシカルボニル基を示す。) を示し、 $R^6$  は水素原子、 $C_1$ - $C_6$  アルキル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキル基、 $C_3$ - $C_6$  アルケニル基、ハロ  $C_3$ - $C_6$  アルケニル基、 $C_3$ - $C_6$  アルキニル基、 $C_3$ - $C_6$  シクロアルキル基、ハロ  $C_3$ - $C_6$  シクロアルキル基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルカルボニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルカルボニル基、 $C_1$ - $C_6$  アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキル基、 $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基又は  $C_1$ - $C_6$  アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル  $C_1$ - $C_4$  アルコキシカルボニル基を示す。

【0010】フェニル  $C_1$ - $C_4$  アルキル基、同一又は異なるても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキル基、 $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基又は  $C_1$ - $C_6$  アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル  $C_1$ - $C_4$  アルキル基、複素環基又は同一若しくは異なるても良く、ハロ

ゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。)を示す。)を示す。

【0011】又、 $R^1$ は $A^1$ と結合して、1~2個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い5~8員環を形成することができる。 $R^2$ 及び $R^3$ は同一又は異なっても良く、水素原子、 $C_3-C_6$ シクロアルキル基又は $-A^2-R^5$ (式中、 $A^2$ 及び $R^5$ は前記に同じ。)を示す。又、 $R^2$ は $A^1$ 又は $R^1$ と結合して、1~2個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い5~7員環を形成することができる。

【0012】 $R^4$ は $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_3-C_6$ アルケニル基、 $C_3-C_6$ アルキニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_3-C_6$ シクロアルキル基、 $C_1-C_4$ アルコキシ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_4$ アルコキシカルボニル $C_1-C_6$ アルキル基、シアノ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_4$ アルキカルボニル $C_1-C_6$ アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニル $C_1-C_4$ アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、

【0013】 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル $C_1-C_4$ アルキル基、フェニルカルボニル $C_1-C_4$ アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル $C_1-C_4$ アルキル基を示す。又、 $R^4$

は $A^1$ 又は $R^1$ と結合して、1~2個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い5~7員環を形成することができる。

【0014】 $n$ は0~1の整数を示す。 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$ 及び $X^4$ は同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_3-C_6$ シクロアルキル基、ハロ $C_3-C_6$ シクロアルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、

【0015】ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^3-R^8$ (式中、 $A^3$ は $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C$ ( $=NOR^9$ )-(式中、 $R^9$ は水素原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_3-C_6$ アルケニル基、 $C_3-C_6$ アルキニル基、 $C_3-C_6$ シクロアルキル基、フェニル $C_1-C_4$ アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_3-C_6$ アルケニル基、 $C_3-C_6$ アルキニル基、 $C_3-C_6$ シクロアルキル基、フェニル $C_1-C_4$ アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル $C_1-C_4$ アルキル基を示す。)、 $C_1-C_6$ アルキレン基、ハロ $C_1-C_6$ アルキレン基、 $C_2-C_6$ アルケニレン基、ハロ $C_2-C_6$ アルケニレン基、 $C_2-C_6$ アルキニレン基又はハロ $C_3-C_6$ アルキニレン基を示し、

(1)  $A^3$ が $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 又は $-SO_2-$ を示す場合、 $R^8$ はハロ $C_3-C_6$ シクロアルキル基、ハロ $C_3-C_6$ シクロアルケニル基、フェニル基、同一又は異な

つても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフイニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、

【0017】ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ  $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ  $C_1-C_6$ アルキルアミノ基又は  $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、モノ  $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ  $C_1-C_6$ アルキルアミノ基又は  $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は- $A^4-R$

<sup>10</sup> (式中、A<sup>4</sup> は C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニレン基、ハロ C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニレン基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニレン基又はハロ C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニレン基を示し、R<sup>10</sup>は水素原子、ハログン原子、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル基、ハロ C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル基、

【0018】 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基又は $-A^5-R^{11}$ （式中、 $A^5$ は $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 又は $-C(=O)-$ を示し、 $R^{11}$ は $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_3-C_6$ アルケニル基、ハロ $C_3-C_6$ アルケニル基、 $C_3-C_6$ アルキニル基、ハロ $C_3-C_6$ アルキニル基、 $C_3-C_6$ シクロアルキル基、ハロ $C_3-C_6$ シクロアルキル基、

【0019】フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ  $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ  $C_1-C_6$ アル

キルアミノ基又は  $C_1-C_6$  アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$  アルキル基、ハロ  $C_1-C_6$  アルキル基、 $C_1-C_6$  アルコキシ基、ハロ  $C_1-C_6$  アルコキシ基、 $C_1-C_6$  アルキルチオ基、ハロ  $C_1-C_6$  アルキルチオ基、 $C_1-C_6$  アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1-C_6$  アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$  アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1-C_6$  アルキルスルホニル基、モノ  $C_1-C_6$  アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ  $C_1-C_6$  アルキルアミノ基又は  $C_1-C_6$  アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基を示す。) を示す。) を示し、

【0020】(2)  $A^3$  が  $-C$  ( $=O$ ) 一又は  $-C$  (=NOR<sup>9</sup>) 一 (式中、R<sup>9</sup> は前記に同じ。) を示す場合、R<sup>8</sup> は C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、ハロ C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル基、ハロ C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、モノ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、フェニル基；同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又は C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニルアミノ基、

【0021】同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上有する置換フェニルアミノ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される



【0028】又、フェニル環上の隣り合ったX<sup>1</sup>及びX<sup>2</sup>、X<sup>3</sup>及びX<sup>4</sup>又はX<sup>3</sup>及びX<sup>4</sup>は一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又は C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。

【0029】Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup>、Y<sup>3</sup>、Y<sup>4</sup>及びY<sup>5</sup>は同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又は C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。Qは農業上許容しうるアニオンから選択される化合物を示し、mは1乃至2の整数を示す。}で表されるフタル酸ジアミド誘導体及び該化合物を有効成分とする農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関するものである。

【0031】複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又は C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。Qは農業上許容しうるアニオンから選択される化合物を示し、mは1乃至2の整数を示す。}で表されるフタル酸ジアミド誘導体及び該化合物を有効成分とする農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関するものである。

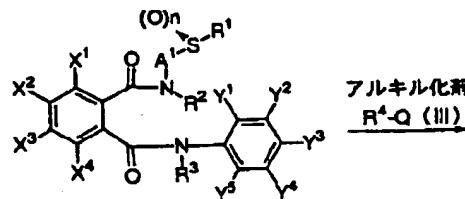
### 【0032】

【発明の実施の形態】本発明の一般式(I)で表されるフタル酸ジアミド誘導体の一般式(I)の定義において、「ハロゲン原子」とは塩素原子、臭素原子、沃素原子又はフッ素原子を示し、「C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル」とは、例えばメチル、エチル、n-プロピル、i-ブロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、n-ヘキシル等の直鎖又は分枝状の炭素原子数1～6個のアルキルを示し、「ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル」とは、同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は分枝状の炭素原子数1～6個のアルキルを示し、「C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン」はメチレン、エチレン、プロピレン、トリメチレン、ジメチルメチレン、テトラメチレン、イソブチレン、ジメチルエチレン、オクタメチレン等の直鎖又は分枝状の炭素原子数1～8個のアルキレンを示す。又、「R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>はお互いに結合して1～3個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い4～7員環」としては、例えばアゼチジン環、ピロリジン環、ピロリン環、ピペリジン環、イミダゾリジン環、イミダゾリジン環、オキサゾリジン環、チアゾリジン環、イソキサゾリジン環、イソチアゾリジン環、テトラヒドロピリジン環、ピペラジン環、モルホリン環、チオモルホリン環、ジオキサン環、ジチアジン環等を例示することができる。

【0033】「複素環基」としては、例えばピリジル基、ピリジン-N-オキシド基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフリル基、チエニル基、テトラヒドロチエニル基、テトラヒドロピラニル基、テトラヒドロ

チオピラニル基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピラゾリル基等を例示することができ、又「複素環基」は「縮合複素環基」を示すことができ、例えばナフタレン、テトラヒドロナフタレン、インデン、インダン、キノリン、キナゾリン、インドール、インドリン、クロマン、イソクロマン、ベンゾジオキサン、ベンゾジオキソール、ベンゾフラン、ジヒドロベンゾフラン、ベンゾチオフェン、ジヒドロベンゾチオフェン、ベンゾオキサゾール、ベンゾチアゾール、ベンズイミダゾール、インダゾール等を例示することができる。

**【0034】**本発明の一般式(I)で表されるフタル酸ジアミド誘導体は、その構造式中に1つ又は複数個の不斉炭素原子又は不斉中心を含む場合があり、2種以上の光学異性体及びジアステレオマーが存在する場合もあり、本発明は各々の光学異性体及びそれらが任意の割合で含



(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>(II)、R<sup>4</sup>、A<sup>1</sup>、X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>、X<sup>3</sup>、X<sup>4</sup>、Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup>、Y<sup>3</sup>、Y<sup>4</sup>、Y<sup>5</sup> n、Q及びmは前記に同じ。)

一般式(II)で表されるフタル酸ジアミド類と一般式(I)で表されるアルキル化剤とを不活性溶媒の存在又は不存在下に反応させることにより、一般式(I)で表されるフタル酸ジアミド誘導体を製造することができる。

又、場合によっては銀や水銀の塩(AgBF<sub>4</sub>、AgC<sub>1</sub>O<sub>4</sub>等)の存在下に反応させることにより、対応するBF<sub>4</sub><sup>-</sup>、ClO<sub>4</sub><sup>-</sup>等を対アニオンとして有する一般式(I)で表されるフタル酸ジアミド誘導体を製造することもできる。

#### **【0036】(1) 一般式(II)→一般式(I)**

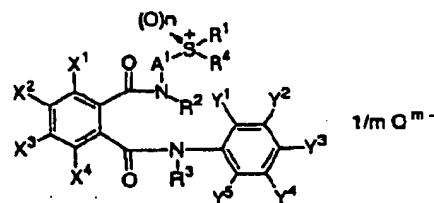
本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えはベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の塩素化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、メタノール、エタノール等のアルコール類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル等のニトリル類、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶

まれる混合物をも全て包含するものである。本発明の一般式(I)で表されるフタル酸ジアミド誘導体は、その構造式中に炭素原子-炭素原子の二重結合又は炭素原子-窒素原子の二重結合に由来する2種の幾何異性体が存在する場合もあるが、本発明は各々の幾何異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。又、化合物によっては非水和物及び水和物も含むものである。

**【0035】**本発明の一般式(I)で表されるフタル酸ジアミド誘導体は、例えは下記に図示する製造方法により製造することができるが、本発明は、実験化学講座(丸善、第4版、1992)、24巻、373頁に記載の方法等でも製造できるが、これらに限定されるものではない。

#### **製造方法1.**

#### **【化3】**



媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

**【0037】**一般式(III)で表されるアルキル化剤としては、ハロゲン化アルキル、オキソニウム塩、硫酸エステル、スルホン酸エステル、フルオロスルホン酸エステル、トリフルオロスルホン酸エステル、ジアルコキソニウム塩、ヨードニウム塩等を使用することができる。本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。本反応は必要に応じて脱水条件下で反応を行うこともできる。

**【0038】**反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の還流温度下で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で適宜選択すれば良い。反応終了後、目的物を含む反応系から常法に従って単離すれば良く、必要に応じて再結晶等で精製することにより目的物を製造することができる。一般式(II)で表されるフタル酸ジアミド類は特開平11-240857号公報及び本願出願人の出願である特願平11-214000号等に記載の方法により製造することができる。

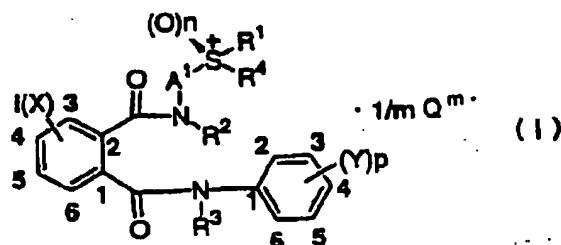
**【0039】**以下に一般式(I)で表されるフタル酸ジアミド誘導体の代表的な化合物を第1表に例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。以下の表において、Meとはメチル基を、Etとはエチル基を、n-Prとはノルマルプロピル基を、i-Prとはイソプロ

ピル基を、Phとはフェニル基を、Pyと/orとはピリジル基を、Tsとはトルエンスルホニル基を示す。又、Q-1はMeOSO<sub>3</sub>を、Q-2はp-TsOを、Q-3はMeSO<sub>3</sub>を、Q-4はClO<sub>4</sub>を、Q-5はBF<sub>4</sub>

<sub>4</sub>を、Q-6はSbF<sub>6</sub>を、Q-7はCF<sub>3</sub>SO<sub>3</sub>を、Q-8はFSO<sub>3</sub>を示す。

一般式(I)；

【化4】



【0040】

第1表 (n = 0, R<sup>2</sup> = R<sup>3</sup> = H, m = 1)

No	N-A <sup>1</sup> -S	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	X <sup>1</sup> -X <sup>4</sup>	Y <sup>1</sup> -Y <sup>5</sup>	Q	融点°C
1	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	Me	Me	3-Br	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	
2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	Me	Me	3-Br	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	211
3	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-Cl	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	
4	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-Cl	4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	
5	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-F	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	
6	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-NO <sub>2</sub>	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	
7	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	195
8	-C(Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	200
9	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-Br	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Q-1	115
10	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	118
11	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Et	Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	200
12	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-Br	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	I	
13	-C(Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	I	
14	-C(Me) <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	I	
15	-C(Me) <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	I	
16	-C(Me) <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	I	
17	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	I	
18	-CH(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	I	
19	-CH(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	I	
20	-CH(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	I	
21	-CH(Me)CH(Me)-	Me	Me	3-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	I	
22	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	I	
23	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	I	

【0041】

第1表 (続き)

No	N-A <sup>1</sup> -S	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	X <sup>1</sup> -X <sup>4</sup>	Y <sup>1</sup> -Y <sup>5</sup>	Q	融点°C
24	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Et	Et	3-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	I	
25	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-Cl	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	I	
26	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-F	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	I	
27	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	4-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	

28	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-NO <sub>2</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I
29	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3, 4-Cl <sub>2</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I
30	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-Cl-4-F	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I
31	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	6-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I
32	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	4-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	I
33	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-CF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I
34	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-OCF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I
35	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I-4-F	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I
36	-C(Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Q-1 108
37	-CH(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I 197
38	-C(Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Br 115
39	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Et	Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I
40	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	n-Pr	Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I
41	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	i-Pr	Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I
42	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Ph	Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I
43	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Et	Me	3-Br	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	I
44	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	n-Pr	Me	3-I	4-OCF <sub>3</sub>	I
45	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	i-Pr	Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Q-1
46	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Ph	Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Q-5

【0042】

第1表 (続き)

No	N-A <sup>1</sup> -S	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	X <sup>1</sup> -X <sup>4</sup>	Y <sup>1</sup> -Y <sup>5</sup>	Q	融点°C
47	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	Br	
48	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Cl-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	
49	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	I	
50	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-F-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	
51	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-OMe-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	
52	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Et-4-C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I	
53	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-Cl	2-Me-4-OCHF <sub>2</sub>	I	
54	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-3-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	
55	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-3-C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I	
56	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-5-C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I	
57	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-SCHF <sub>2</sub>	I	
58	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-SOCHF <sub>2</sub>	I	
59	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	I	
60	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-Cl	I	
61	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	I	
62	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	I	
63	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	
64	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-SC <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I	
65	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Cl-4-OCF <sub>3</sub>	I	
66	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-SOC <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I	
67	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I	
68	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-SCF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	
69	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-SOCF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	

【0043】

第1表 (続き)

No	N-A <sup>1</sup> -S	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	X <sup>1</sup> -X <sup>4</sup>	Y <sup>1</sup> -Y <sup>5</sup>	Q	融点°C
70	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	
71	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I	
72	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-OC(C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> ) ≡C(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	
73	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-C1-4-OCF <sub>2</sub> CHFO-5	I	
74	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-C1-4-OCHFCF <sub>2</sub> O-5	I	
75	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-OMe-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	
76	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-OEt-4-C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I	
77	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-C1-3-OCF <sub>2</sub> CHFO-4	I	
78	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-C1-3-OCHFCF <sub>2</sub> O-4	I	
79	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-3-OCF <sub>2</sub> CHFO-4	I	
80	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-3-OCHFCF <sub>2</sub> O-4	I	
82	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> CHFO-5	I	
83	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-OCHFCF <sub>2</sub> O-5	I	
84	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -5-F	I	
85	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -3-F	I	
86	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> CHFCF <sub>3</sub>	I	
87	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-O-(3-C1- 5-CF <sub>3</sub> -2-Pyi)	I	
88	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-O-(4-C1Ph)	I	
89	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-O-(4-CF <sub>3</sub> Ph)	I	

【0044】

第1表 (続き)

No	N-A <sup>1</sup> -S	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	X <sup>1</sup> -X <sup>4</sup>	Y <sup>1</sup> -Y <sup>5</sup>	Q	融点°C
90	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-O-(4-CF <sub>3</sub> OPh)	I	
91	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-O-(4-CF <sub>3</sub> SPh)	I	
92	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-(4-CF <sub>3</sub> Ph)	I	
93	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-(4-C1Ph)	I	
94	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-C ≡C(4-C1Ph)	I	
95	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-CH =CH(4-C1Ph)	I	
96	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-S-(4-C1Ph)	I	
97	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	
98	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> CHFOCF <sub>3</sub>	I	
99	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	
100	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	
101	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	4-OCF <sub>3</sub>	I	
102	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	I	
103	-CH(Me)CH <sub>2</sub> -	Me	Me	3-I	2-Me-4-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> (4-C1Ph)	I	

104	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	3-I	2-Me-4-C(=O) -(4-ClPh)	I
105	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	3-I	2-Me-4-C(=O)-CH <sub>2</sub> -(4-ClPh)	I
106	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	3-I	2-Me-4-C(=NO-Me) -(4-ClPh)	I

【0045】

第1表 (続き)

No	N-A <sup>1</sup> -S	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	X <sup>1</sup> -X <sup>4</sup>	Y <sup>1</sup> -Y <sup>5</sup>	Q	融点℃
107	$-\text{C}(\text{Me})_2\text{CH}_2-$	Me	Me	3-I	2-Me-4-C(=NO-Me)CF <sub>3</sub>	I	
108	$-\text{C}(\text{Me})_2\text{CH}_2-$	Me	Me	3-I	2-Me-4-C(=O)-CF <sub>3</sub>	I	
109	$-\text{C}(\text{Me})_2\text{CH}_2-$	Me	Me	3-I	2-Me-4-C≡C-CF <sub>3</sub>	I	
110	$-\text{C}(\text{Me})_2\text{CH}_2-$	Me	Me	3-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	Br	
111	$-\text{C}(\text{Me})_2\text{CH}_2-$	Me	Me	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	
112	$-\text{C}(\text{Me})_2\text{CH}_2-$	Me	Me	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Q-4	
113	$-\text{C}(\text{Me})_2\text{CH}_2-$	Me	Me	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Q-5	
114	$-\text{C}(\text{Me})_2\text{CH}_2-$	Me	Me	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Q-3	
115	$-\text{C}(\text{Me})_2\text{CH}_2-$	Me	Me	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Q-2	
116	$-\text{C}(\text{Me})_2\text{CH}_2-$	Me	Me	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Q-6	
117	$-\text{C}(\text{Me})_2\text{CH}_2-$	Me	Me	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Q-7	
118	$-\text{C}(\text{Me})_2\text{CH}_2-$	Me	Me	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Q-8	
119	$-\text{C}(\text{Me})_2\text{CH}_2-$	Me	Me	3-I-4-Me	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	
120	$-\text{C}(\text{Me})_2\text{CH}_2-$	Me	Me	3-I-4-OMe	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	
121	$-\text{C}(\text{Me})_2\text{CH}_2-$	Me	Me	3-Cl-4-Me	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	
122	$-\text{C}(\text{Me})_2\text{CH}_2-$	Me	Me	3-Br-4-Me	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	

【0046】以下に本発明の代表的な実施例を例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

【0047】

【実施例】製造例1. ジメチル 3-[2-[N-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)カルバモイル]-6-ヨードベンゾイルアミノ]プロピルスルホニウム ヨージド (化合物No. 10) の製造。  
3-ヨード-N<sup>1</sup>-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-N<sup>2</sup>-(3-(メチルチオ)プロピル)フタル酸ジアミド0.25 g をクロロホルム5 ml に溶解し、該溶液にヨウ化メチル0.2 g を加えて、還流加熱下に5時間攪拌した。反応終了後、反応混液を氷冷し、析出した結晶を濾集することにより、目的物0.12 gを得た。

物性:m. p. 118℃ 収率: 40%

【0048】製造例2. ジメチル 2-[2-[N-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)カルバモイル]-6-ブロモベンゾイルアミノ]プロピルスルホニウム モノメチルスルフェート (化合物No. 9) の製造。

3-ブロモ-N<sup>1</sup>-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-

2-メチルフェニル)-N<sup>2</sup>-[1-メチル-2-(ジメチルスルホニル)エチル]フタル酸ジアミド1.18 g をフルオロベンゼン20 ml に溶解し、該溶液にジメチル硫酸0.28 g を加えて、還流加熱下に5時間攪拌した。反応終了後、反応混液を氷冷し、析出した結晶を濾集することにより、目的物0.32 gを得た。  
物性:m. p. 115℃ 収率: 22%

【0049】本発明の一般式(I)で表されるフタル酸ジアミド誘導体を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤は水稻、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等を加害する各種農林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫等の害虫防除に適しており、例えリンゴコカクモンハマキ (Adoxophyes orana fasciata) 、チャノコカクモンハマキ (Adoxophyes sp.) 、リンゴコシンクイ (Grapholita inopinata) 、ナシヒメシンクイ (Grapholita moesta) 、マメシンクイガ (Leguminivora glycinivorella) 、クワハマキ (Olethreutes mori) チャノホソガ (Caloptilia thelivora) 、リンゴホソガ (Caloptilia zachrysa) 、キンモンホソガ (Phyllonorycter ringonella) 、ナシホソガ (Spulerrina astaurota) 、モンシロチョウ (Piers rapae crucivora) 、オオタバコガ類

(*Heliothis* sp.)、コドリンガ (*Laspeyresia pomonella*)、コナガ (*Plutella xylostella*)、リンゴヒメシンクイ (*Argyresthia conjugella*)、

【0050】モモシンクイガ (*Carposina niponensis*)、ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、コブノメイガ (*Chnaphalocrocis medinalis*)、チャマダラメイガ (*Ephestia elutella*)、クワノメイガ (*Glyphodes pyloalis*)、サンカメイガ (*Scirpophaga incertulas*)、イチモンジセシリ (*Parnara guttata*)、アワヨトウ (*Pseudaletia separata*)、イネヨトウ (*Sesamia inferens*)、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、シロイチモンジョトウ (*Spodoptera exigua*)、等の鱗翅目害虫、フタテンヨコバイ (*Macrosteles fascifrons*)、ツマグロヨコバイ (*Nephrotettix cincticeps*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*)、ミカンキジラミ (*Diaphorina citri*)、ブドウコナジラミ (*Aleurolobus taonabae*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*)、ニセダイコンナブラムシ (*Lipaphis erysimi*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、

【0051】ツノロウムシ (*Ceroplastes ceriferus*)、ミカンワタカイガラムシ (*Pulvinaria aurantii*)、ミカンマルカイガラムシ (*Pseudaonidia duplex*)、ナシマルカイガラムシ (*Comstockaspis perniciosa*)、ヤノネカイガラムシ (*Unaspis yanonensis*) 等の半翅目害虫、ネグサレセンチュウ (*Pratylenchus sp.*)、ヒメゴガネ (*Anomala rufocuprea*)、マメコガネ (*Popillia japonica*)、タバコシバンムシ (*Lasioderma serricorne*)、ヒラタキクイムシ (*Lyctus brunneus*)、ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintiota punctata*)、アズキゾウムシ (*Callosobruchus chinensis*)、ヤサイゾウムシ (*Listroderes costirostris*)、コクゾウムシ (*Sitophilus zeamais*)、ワタミゾウムシ (*Anthonomus gradis gradis*)、イネミズゾウムシ (*Li ssorhoptrus oryzophilus*)、ウリハムシ (*Aulacophora femoralis*)、イネドロオイムシ (*Oulema oryzae*)、

【0052】キスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*)、マツノキイムシ (*Tomicus piniperda*)、コロラドポテトビートル (*Leptinotarsa decemlineata*)、メキシカンビーンビートル (*Epilachna varivestis*)、コーンルートワーム類 (*Diabrotica sp.*) 等の甲虫目害虫、ウリミバエ (*Dacus (Zeugodacus) cucurbitae*)、ミカンコミバエ (*Dacus (Bactrocera) dorsalis*)、イネハモグリバエ (*Agromyza oryzae*)、タマネギバエ (*Delia antiqua*)、タネバエ (*Delia platura*)、ダイズサヤタマバエ (*Asphondylia sp.*)、イエバエ (*Musca domestica*)、アカイエカ (*Culex pipiens pipiens*) 等の双翅目害虫、ミナミネグサレセンチュウ (*Pratylench*

*us coffeae*)、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*)、ネコブセンチュウ (*Meloidogyne sp.*)、ミカンネセンチュウ (*Tylenchulus semipenetrans*)、ニセネグサレセンチュウ (*Aphelenchus avenae*)、ハガレセンチュウ (*Aphelenchoides ritzemabisi*) 等のハリセンチュウ目害虫等に対して強い殺虫効果を有するものである。

【0053】本発明の一般式(I)で表されるフタル酸ジアミド誘導体を有効成分とする農園芸用殺虫剤は水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等に被害を与える前記害虫に対して顕著な防除効果を有するものであるので、害虫の発生が予測される時期に合わせて、害虫の発生前又は発生が確認された時点で水田、畑、果樹、野菜、その他の作物、花卉等の水田水、茎葉又は土壤に処理することにより本発明の農園芸用殺虫剤の所期の効果が奏せられるものである。

【0054】本発明の農園芸用殺虫剤は農薬製剤上の常法に従い、使用上都合の良い形状に製剤して使用するのが一般的である。即ち、一般式(I)で表されるフタル酸ジアミド誘導体はこれらを適當な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適當な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させ、適宜の剤形、例えば懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、粒剤、粉剤、錠剤等に製剤して使用すれば良い。本発明で使用できる不活性担体としては固体又は液体の何れであっても良く、固体の担体になりうる材料としては、例えばダイズ粉、穀物粉、木粉、樹皮粉、鋸粉、タバコ茎粉、クルミ殻粉、ふすま、繊維素粉末、植物エキス抽出後の残渣、粉碎合成樹脂等の合成重合体、粘土類（例えばカオリン、ペントナイト）、

【0055】酸性白土等）、タルク類（例えばタルク、ピロフィライド等）、シリカ類（例えば珪藻土、珪砂、雲母、ホワイトカーボン〔含水微粉珪素、含水珪酸ともいわれる合成高分散珪酸で、製品により珪酸カルシウムを主成分として含むものもある。〕）、活性炭、イオウ粉末、軽石、焼成珪藻土、レンガ粉碎物、フライアッシュ、砂、炭酸カルシウム、磷酸カルシウム等の無機鉱物性粉末、硫安、燐安、硝安、尿素、塩安等の化学肥料、堆肥等を挙げることができ、これらは単独で若しくは二種以上の混合物の形で使用される。

【0056】液体の担体になりうる材料としては、それ自体溶媒能を有するものの他、溶媒能を有さずとも補助剤の助けにより有効分化合物を分散させうこととなるものから選択され、例えば代表例として次に挙げる担体を例示できるが、これらは単独で若しくは2種以上の混合物の形で使用され、例えば水、アルコール類（例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコール等）、ケトン類（例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサン等）、エーテル

類（例えばエチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラン等）、脂肪族炭化水素類（例えばケロシン、鉱油等）、芳香族炭化水素類（例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等）、ハログン化炭化水素類（例えばジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素、塩素化ベンゼン等）、エステル類（例えば酢酸エチル、ジイソブリルフタレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート等）、アミド類（例えばジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等）、ニトリル類（例えばアセトニトリル等）、ジメチルスルホキシド類等を挙げることができる。

【0057】他の補助剤としては次に例示する代表的な補助剤をあげることができ、これらの補助剤は目的に応じて使用され、単独で、ある場合は二種以上の補助剤を併用し、又ある場合には全く補助剤を使用しないことも可能である。有効成分化合物の乳化、分散、可溶化及び／又は湿润の目的のために界面活性剤が使用され、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート、アルキルアリールスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸縮合物、リグニンスルホン酸塩、高級アルコール硫酸エステル等の界面活性剤を例示することができる。又、有効成分化合物の分散安定化、粘着及び／又は結合の目的のために、次に例示する補助剤を使用することもでき、例えばカゼイン、ゼラチン、澱粉、メチセルロース、カルボキシメチセルロース、アラビアゴム、ポリビニルアル

#### 製剤例1.

第1表記載の化合物	50部
キシレン	40部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	10部
以上を均一に混合溶解して乳剤とする。	

#### 製剤例2.

第1表記載の化合物	3部
クレー粉末	82部
珪藻土粉末	15部
以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。	

#### 【0061】

#### 製剤例3.

第1又は記載の化合物	5部
ベントナイトとクレーの混合粉末	90部
リグニンスルホン酸カルシウム	5部
以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする	

#### 。

#### 製剤例4.

第1表記載の化合物	20部
-----------	-----

コール、松根油、糠油、ベントナイト、リグニンスルホン酸塩等の補助剤を使用することもできる。

【0058】固体製品の流動性改良のために次に挙げる補助剤を使用することもでき、例えばワックス、ステアリン酸塩、磷酸アルキルエステル等の補助剤を使用できる。懸濁性製品の解こう剤として、例えばナフタレンスルホン酸縮合物、縮合磷酸塩等の補助剤を使用することもできる。消泡剤としては、例えばシリコーン油等の補助剤を使用することもできる。有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、例えば粉剤或いは粒剤とする場合は0.01～50重量%、又乳剤或いは水和剤とする場合も同様0.01～50重量%が適当である。

【0059】本発明の農園芸用殺虫剤は各種害虫を防除するためにそのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で病害防除に有効な量を当該害虫の発生が予測される作物若しくは発生が好ましくない場所に適用して使用すれば良い。本発明の農園芸用殺虫剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象害虫、作物の生育状況、害虫の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0.1g～10kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。本発明の農園芸用殺虫剤は、更に防除対象病害虫、防除適期の拡大のため、或いは薬量の低減をはかる目的で他の農園芸用病虫害防除剤と混合して使用することも可能である。

【0060】以下に本発明の代表的な実施例及び試験例を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。尚、処方例中、部とあるのは重量部を示す。

カオリンと合成高分散珪酸	75部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルとアル	
キルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	5部

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

【0062】試験例1. コナガ (*Plutella xylostella*)に対する殺虫試験。  
ハクサイ実生にコナガの成虫を放飼して産卵させ、放飼2日後に産下卵の付いたハクサイ実生を第1表記載の化合物を有効成分とする薬剤を50 ppmに希釈した薬液に約30秒間浸漬し、風乾後に25℃の恒温室に静置した。薬液浸漬6日後に孵化虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、下記基準に従って判定を行った。1区10頭3連制  
〔数1〕

$$\text{補正死虫率 (\%)} = \frac{\text{無処理区孵化虫数} - \text{処理区孵化虫数}}{\text{無処理区孵化虫数}} \times 100$$

【0063】  
判定基準。 A・・・死虫率100%  
B・・・死虫率99%~90%  
C・・・死虫率89%~80%  
D・・・死虫率79%~50%

上記試験の結果、化合物番号2、7、8、9、10、11、36、37及び38がB以上の活性を示した。

【0064】試験例2. ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)に対する殺虫試験。

第1表記載の化合物を有効成分とする薬剤を50 ppmに希釈した薬液にキャベツ葉片（品種：四季種）を約30秒間浸漬し、風乾後に直径9cmのプラスチックシャーレに入れ、ハスモンヨトウ2令幼虫を接種した後、蓋をして25℃の恒温室に静置した。接種8日後に生死虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出した。判定基準は試験例1に従って行った。1区10頭3連制  
〔数2〕

$$\text{補正死虫率 (\%)} = \frac{\text{無処理区生存虫数} - \text{処理区生存虫数}}{\text{無処理区生存虫数}} \times 100$$

上記試験の結果、B以上の活性を示した化合物は化合物番号2、7、8、9、10、11、36、37及び38であった。

【0065】試験例3. チヤノコカクモンハマキ (*Adoxophyes sp.*)に対する殺虫試験。

第1表記載の化合物を有効成分とする薬剤を50 ppmに希釈した薬液にチヤ葉を約30秒間浸漬し、風乾後に直径9cmのプラスチックシャーレに入れ、チヤノコカ

クモンハマキ幼虫を接種した後、25℃、湿度70%の恒温室に静置した。接種8日後に生死虫数を調査し、試験例1の判定基準に従って判定を行った  
1区10頭3連制

上記試験の結果、B以上の活性を示した化合物は化合物番号2、7、8、9、10、11、36、37及び38であった。

フロントページの続き

Fターム(参考) 4H006 AA01 AA03 AB02 TN50  
4H011 AC01 BA01 BB07 BC01 BC07  
BC19 BC20 DA02 DA15 DA16  
DD03 DD04 DH03